

PCT COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

To:

Commissioner
US Department of Commerce
United States Patent and Trademark
Office, PCT
2011 South Clark Place Room
CP2/5C24
Arlington, VA 22202
ETATS-UNIS D'AMERIQUE

in its capacity as elected Office

Date of mailing (day/month/year)

22 May 2001 (22.05.01)

International application No.

PCT/EP00/08647

Applicant's or agent's file reference

BEI9806PCT

International filing date (day/month/year)

05 September 2000 (05.09.00)

Priority date (day/month/year)

06 September 1999 (06.09.99)

Applicant

BEISEL, Günther

1. The designated Office is hereby notified of its election made:



in the demand filed with the International Preliminary Examining Authority on:

06 April 2001 (06.04.01)



in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:

2. The election ☒ was

was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

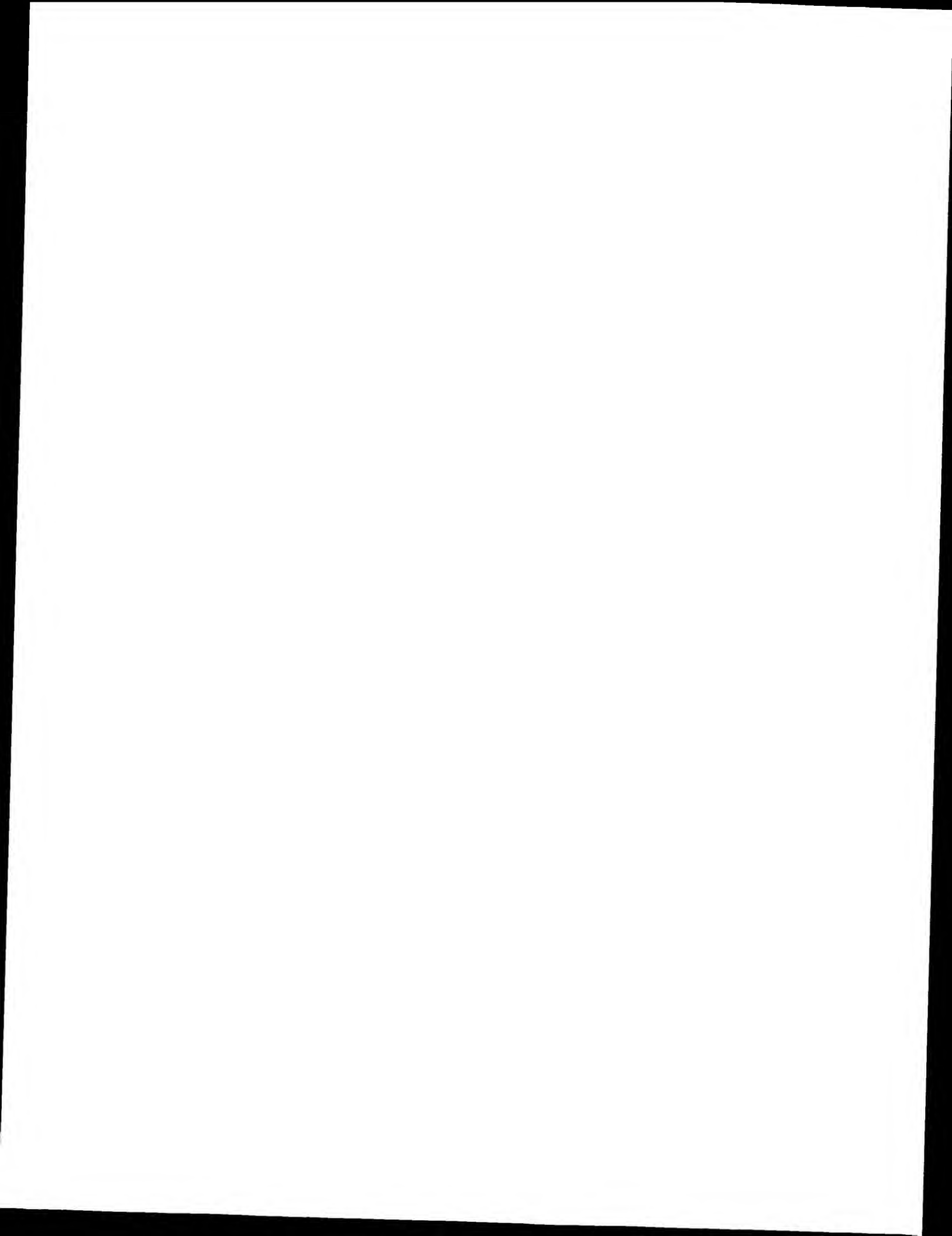
Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Authorized officer

Charlotte ENGER

Telephone No.: (41-22) 338.83.38

EP0008647



VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

| | | |
|--|--|---|
| Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts BEI9806PCT | WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5 | |
| Internationales Aktenzeichen PCT/EP 00/ 08647 | Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 05/09/2000 | (Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 06/09/1999 |
| Anmelder BEISEL, Günther | | |

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 4 Blätter.



Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

1. Grundlage des Berichts

- a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.



Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

- b. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das



in der internationalen Anmeldung in Schriftlicher Form enthalten ist.



zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.



bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.



bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.



Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.



Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2. ☒ Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).

3. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).

4. Hinsichtlich der **Bezeichnung der Erfindung**



wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.



wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

5. Hinsichtlich der **Zusammenfassung**



wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.



wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der **Zeichnungen** ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. ---



wie vom Anmelder vorgeschlagen



weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.



weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.



keine der Abb.

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESCHENNE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|--------------------|
| A | WO 98 23259 A (BEISEL GUENTHER) 4. Juni 1998 (1998-06-04) das ganze Dokument | 1-16 |
| P,X | DE 299 15 668 U (BEISEL GUENTHER) 23. März 2000 (2000-03-23) das ganze Dokument | 1-16 |
| P,X | DE 299 15 656 U (BEISEL GUENTHER) 20. April 2000 (2000-04-20) das ganze Dokument | 1-16 |

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☒ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
Obwohl der Anspruch 16 sich auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen/tierischen Körpers bezieht, wurde die Recherche durchgeführt und gründete sich auf die angeführten Wirkungen der Zusammensetzung.
2. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. ☐ Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- ☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

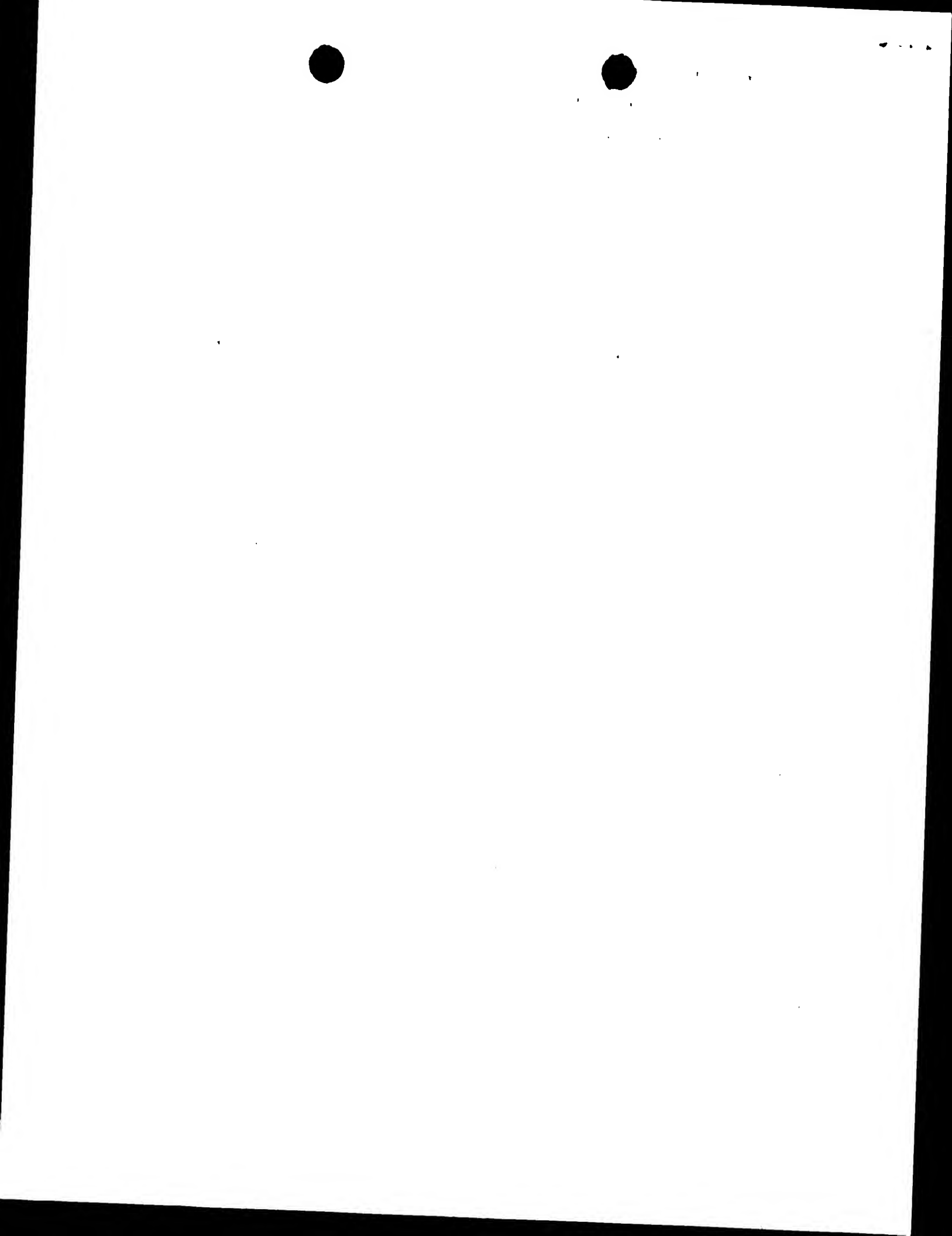
INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 00/08647

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | Datum der Veröffentlichung | Mitglied(er) der Patentfamilie | Datum der Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| EP 0901792 A | 17-03-1999 | DE 19739031 A | 11-03-1999 |
| | | AU 709337 B | 26-08-1999 |
| | | AU 7864098 A | 18-03-1999 |
| | | CA 2245754 A | 05-03-1999 |
| | | DE 29723220 U | 28-05-1998 |
| | | JP 3045388 B | 29-05-2000 |
| | | JP 11139993 A | 25-05-1999 |
| WO 9809617 A | 12-03-1998 | AU 6988696 A | 26-03-1998 |
| | | EP 0936903 A | 25-08-1999 |
| US 3688763 A | 05-09-1972 | GB 1302548 A | 10-01-1973 |
| WO 9823259 A | 04-06-1998, | AU 3091997 A | 22-06-1998 |
| | | BR 9713303 A | 21-03-2000 |
| | | CN 1247467 A | 15-03-2000 |
| | | CZ 9901879 A | 13-10-1999 |
| | | EP 0948316 A | 13-10-1999 |
| | | SI 20007 A | 29-02-2000 |
| | | SK 70299 A | 18-01-2000 |
| DE 29915668 U | 23-03-2000 | KEINE | |
| DE 29915656 U | 20-04-2000 | KEINE | |



VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

REC'D 27 NOV 2001

WIPO PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

T16


| | | |
|---|--|--|
| Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts BEI 9806 PCT | WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416) | |
| Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/08647 | Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 05/09/2000 | Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 06/09/1999 |
| Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A61K9/20 | | |
| Anmelder BEISEL, Günther | | |

- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
 - ☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☒ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☒ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

| | |
|--|--|
| Datum der Einreichung des Antrags 06/04/2001 | Datum der Fertigstellung dieses Berichts 23.11.2001 |
| Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465 | Bevollmächtigter Bediensteter Meyer, J-P Tel. Nr. +49 89 2399 8649 |





I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):
Beschreibung, Seiten:

1-14 ursprüngliche Fassung

Patentansprüche, Nr.:

1-16 ursprüngliche Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
- ☐ Ansprüche, Nr.:
- ☐ Zeichnungen, Blatt:



5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen).

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

III. Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

1. Folgende Teile der Anmeldung wurden nicht daraufhin geprüft, ob die beanspruchte Erfindung als neu, auf erfinderischer Tätigkeit beruhend (nicht offensichtlich) und gewerblich anwendbar anzusehen ist:

☐ die gesamte internationale Anmeldung.

☒ Ansprüche Nr. 16.

Begründung:

☒ Die gesamte internationale Anmeldung, bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. 16 beziehen sich auf den nachstehenden Gegenstand, für den keine internationale vorläufige Prüfung durchgeführt werden braucht (*genaue Angaben*):
siehe Beiblatt

☐ Die Beschreibung, die Ansprüche oder die Zeichnungen (*machen Sie hierzu nachstehend genaue Angaben*) oder die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unklar, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte (*genaue Angaben*):

☐ Die Ansprüche bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unzureichend durch die Beschreibung gestützt, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte.

☐ Für die obengenannten Ansprüche Nr. wurde kein internationaler Recherchenbericht erstellt.

2. Eine sinnvolle internationale vorläufige Prüfung kann nicht durchgeführt werden, weil das Protokoll der Nukleotid- und/oder Aminosäuresequenzen nicht dem in Anlage C der Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen Standard entspricht:

☐ Die schriftliche Form wurde nicht eingereicht bzw. entspricht nicht dem Standard.

☐ Die computerlesbare Form wurde nicht eingereicht bzw. entspricht nicht dem Standard.

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung



| | | |
|--------------------------------|-----------------|-------------|
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche | 4,14 |
| | Nein: Ansprüche | 1-3,5-13,15 |
| Erfinderische Tätigkeit (ET) | Ja: Ansprüche | 14 |
| | Nein: Ansprüche | 4 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (GA) | Ja: Ansprüche | 1-15 |
| | Nein: Ansprüche | |

2. Unterlagen und Erklärungen
siehe Beiblatt

VII. Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist:
siehe Beiblatt



Zu Punkt III

Der Anspruch 16 betrifft die therapeutische Behandlung des menschlichen Körpers, Art. 34(4)(a)(i) und R. 67.1(iv) PCT.

Zu Punkt V

- 1) Es wird auf das folgende Dokument verwiesen:

D1: WO 98 09617

- 2) D1 stellt den nächsten Stand der Technik dar und beschreibt ein Mittel enthaltend ein anmeldungsgemäßes Material in Form eines schwammartigen Gebildes, das mit einer anmeldungsgemäßen Verbindung (z.B. Schellack, Celluloseester wie Celluloseacetat-phthalat oder Hydroxypropylmethylcellulose-phthalat) versehen ist, die im Darm löslich ist (in Form einer Beschichtung oder eines Behältnisses). Anmeldungsgemäße Wirkstoffe können eingesetzt werden.

Es gibt ausserdem keinen Unterschied zwischen dem Verfahren zur Herstellung des schwammartigen Gebildes gemäß D1 und demjenigen gemäß der vorliegenden Anmeldung: beide Gebilde müssen deshalb 3-dimensionale polymere Netzwerke aufweisen.

D1 beschreibt auch die Verwendung des Mittels zur Herstellung von Arzneimitteln, die anmeldungsgemäße Wirkstoffe enthalten, Nahrungsmitteln und Nahrungsergänzungsmitteln.

- 3) Da sich die Gegenstände der Ansprüche 1-3, 5-7, 8-11, 12, 13 und 15 in die Offenbarungen des Dokumenten D1 umfasst sind, sind diese Ansprüche neuheitschädlich getroffen (Artikel 33(2) PCT).
- 4) Für die Bestimmung der Neuheit sei es bemerkt, daß nicht als Unterscheidungsmerkmale anzusehende Angaben über eine beabsichtige besondere Art der Verwendung außer acht gelassen werden.



- 5) Der Gegenstand des Anspruchs 4 ist als neu betrachten werden, weil er nicht ausdrücklich in D1 beschrieben wurde.

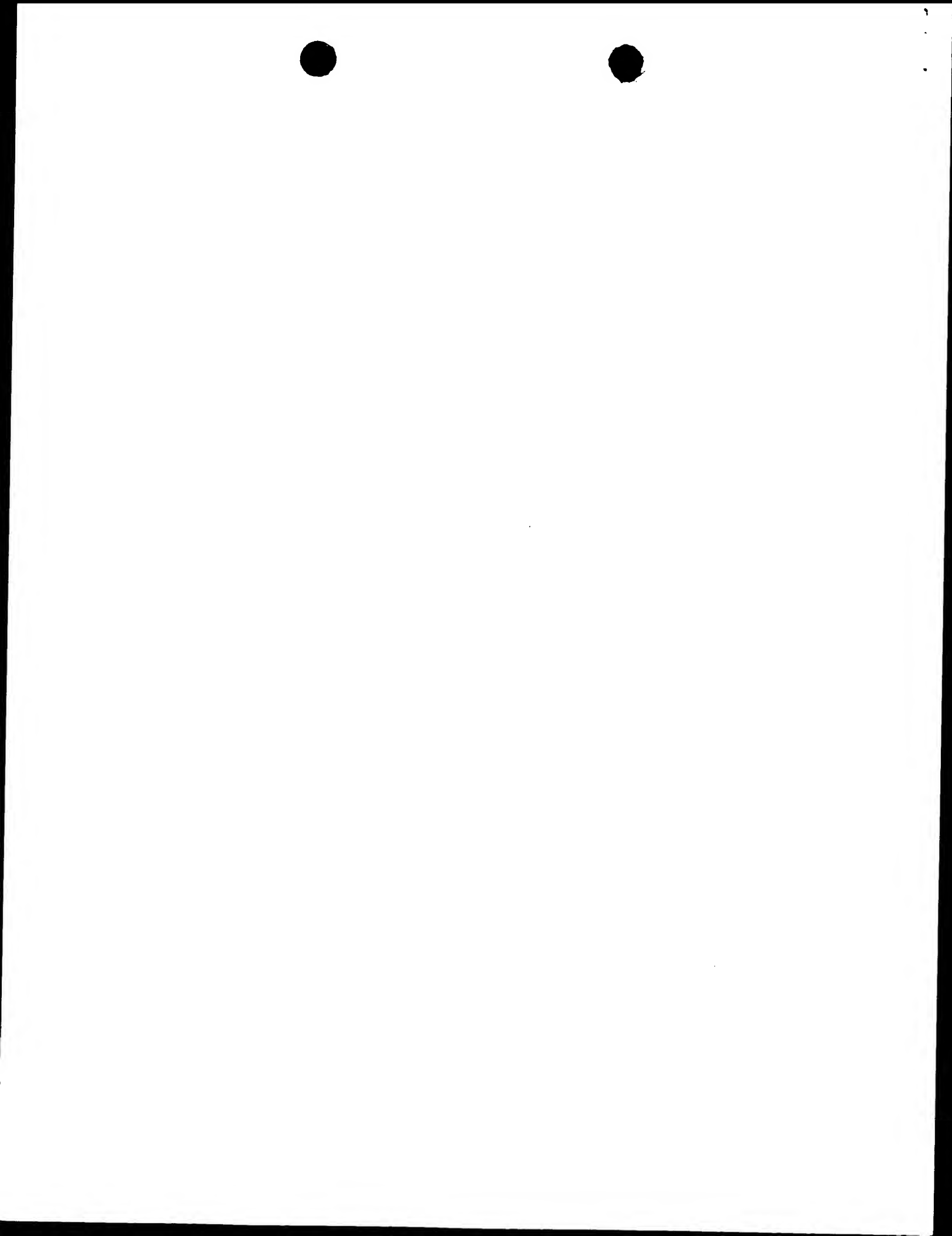
Angesicht der gesamten Offenbarungen des zitierten Stand der Technik stellt jedoch der beanspruchte Merkmal eine übliche Maßnahme zur Lösung der gestellten Aufgabe dar.

Der Gegenstand des Anspruchs 4 beruht somit nicht auf einer erfinderischen Tätigkeit und erfüllt damit nicht das in Artikel 33(3) PCT genannte Kriterium.

- 6) Der Gegenstand des Anspruchs 14 ist weder beschrieben noch in naheliegender Weise aus dem zitierten Stand der Technik ableitbar. Dieser Anspruch entspricht den Bedingungen gemäß Art. 33(2)(3) PCT.
- 7) Für die Beurteilung der Frage, ob der Gegenstand des vorliegenden Anspruchs 16 gewerblich anwendbar sind, gibt es in den PCT-Vertragsstaaten keine einheitlichen Kriterien. Die Patentierbarkeit kann auch von der Formulierung der Ansprüche abhängen. Das EPA beispielsweise erkennt den Gegenstand von Ansprüchen, die auf die medizinische Anwendung einer Verbindung gerichtet sind, nicht als gewerblich anwendbar an; es können jedoch Ansprüche zugelassen werden, die auf eine bekannte Verbindung zur erstmaligen medizinischen Anwendung und die Verwendung einer solchen Verbindung zur Herstellung eines Arzneimittels für eine neue medizinische Anwendung gerichtet sind.

Zu Punkt VII

Im Widerspruch zu den Erfordernissen der Regel 5.1 a) ii) PCT werden in der Beschreibung weder der in dem Dokument D1 offenbarte einschlägige Stand der Technik noch dieses Dokument angegeben.



Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

RECEIVED

AUG 29 2002

TECH CENTER 1600/29003
10/0706/03

| | | |
|--|---|--|
| Applicant's or agent's file reference BEI9806PCT | FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416) | |
| International application No. PCT/EP00/08647 | International filing date (day/month/year) 05 September 2000 (05.09.00) | Priority date (day/month/year) 06 September 1999 (06.09.99) |
| International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 9/20, A61P 1/00 | | |
| Applicant BEISEL, Günther | | |

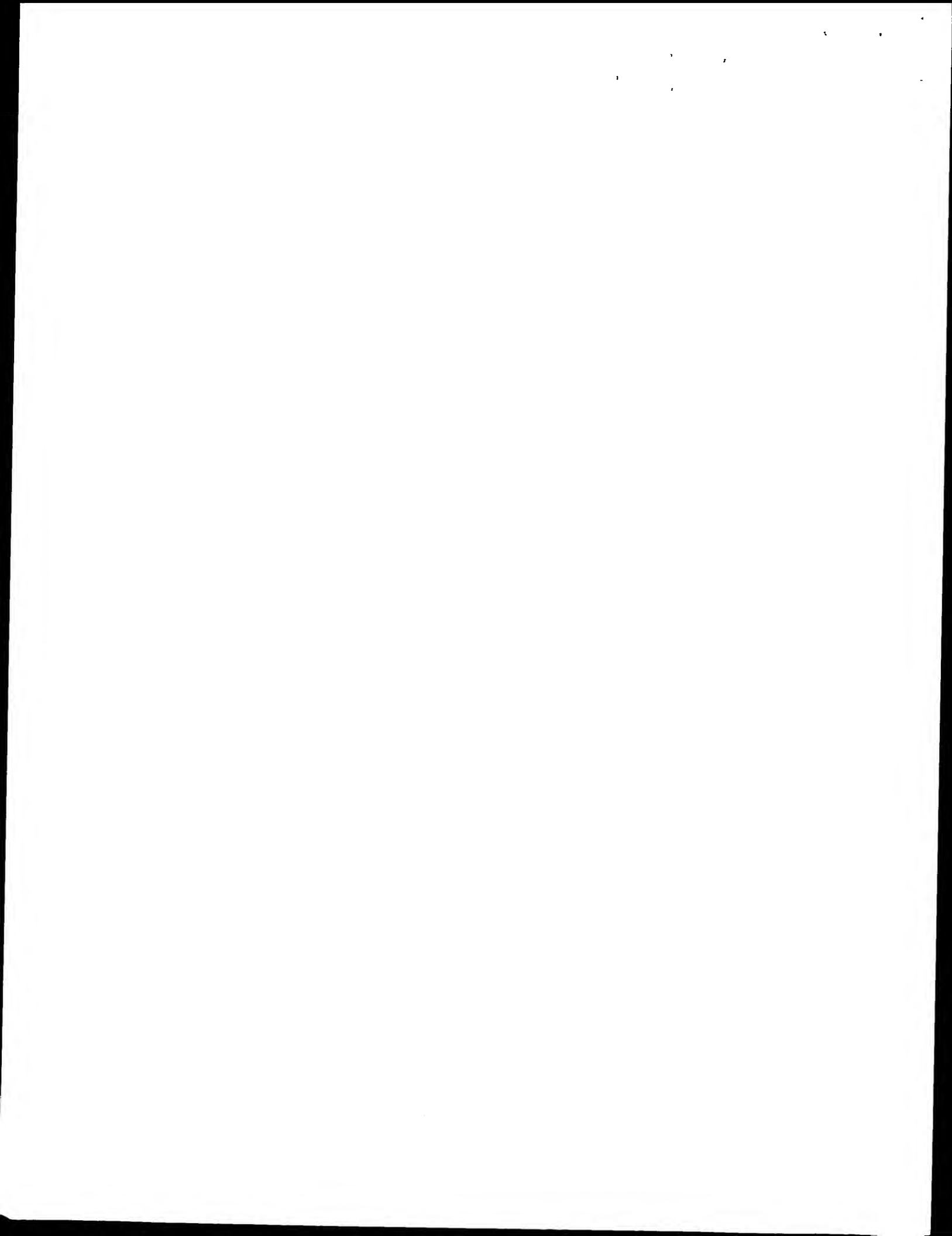
1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.
☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of _____ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☒ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☒ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

| | |
|--|--|
| Date of submission of the demand 06 April 2001 (06.04.01) | Date of completion of this report 23 November 2001 (23.11.2001) |
| Name and mailing address of the IPEA/EP | Authorized officer |
| Facsimile No. | Telephone No. |



INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP00/08647

I. Basis of the report

1. With regard to the **elements** of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☒ the description:
 pages _____ 1-14 _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☒ the claims:
 pages _____ 1-16 _____, as originally filed
 pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the **language**, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.
 These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP00/08647

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

1. The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

☐ the entire international application.

☒ claims Nos. 16

because:

☒ the said international application, or the said claims Nos. 16
relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

See supplemental sheet.

☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. _____
are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ the claims, or said claims Nos. _____ are so inadequately supported
by the description that no meaningful opinion could be formed.

☐ no international search report has been established for said claims Nos. _____

2. A meaningful international preliminary examination cannot be carried out due to the failure of the nucleotide and/or amino acid sequence listing to comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions:

☐ the written form has not been furnished or does not comply with the standard.

☐ the computer readable form has not been furnished or does not comply with the standard.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 00/08647

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: III.1

Claim 16 relates to the therapeutic treatment of the human body (PCT Article 34(4)(a)(i) and Rule 67.1(iv)).

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 00/08647

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

| | | | |
|-------------------------------|--------|---------------|-----|
| Novelty (N) | Claims | 4, 14 | YES |
| | Claims | 1-3, 5-13, 15 | NO |
| Inventive step (IS) | Claims | 14 | YES |
| | Claims | 4 | NO |
| Industrial applicability (IA) | Claims | 1-15 | YES |
| | Claims | | NO |

2. Citations and explanations

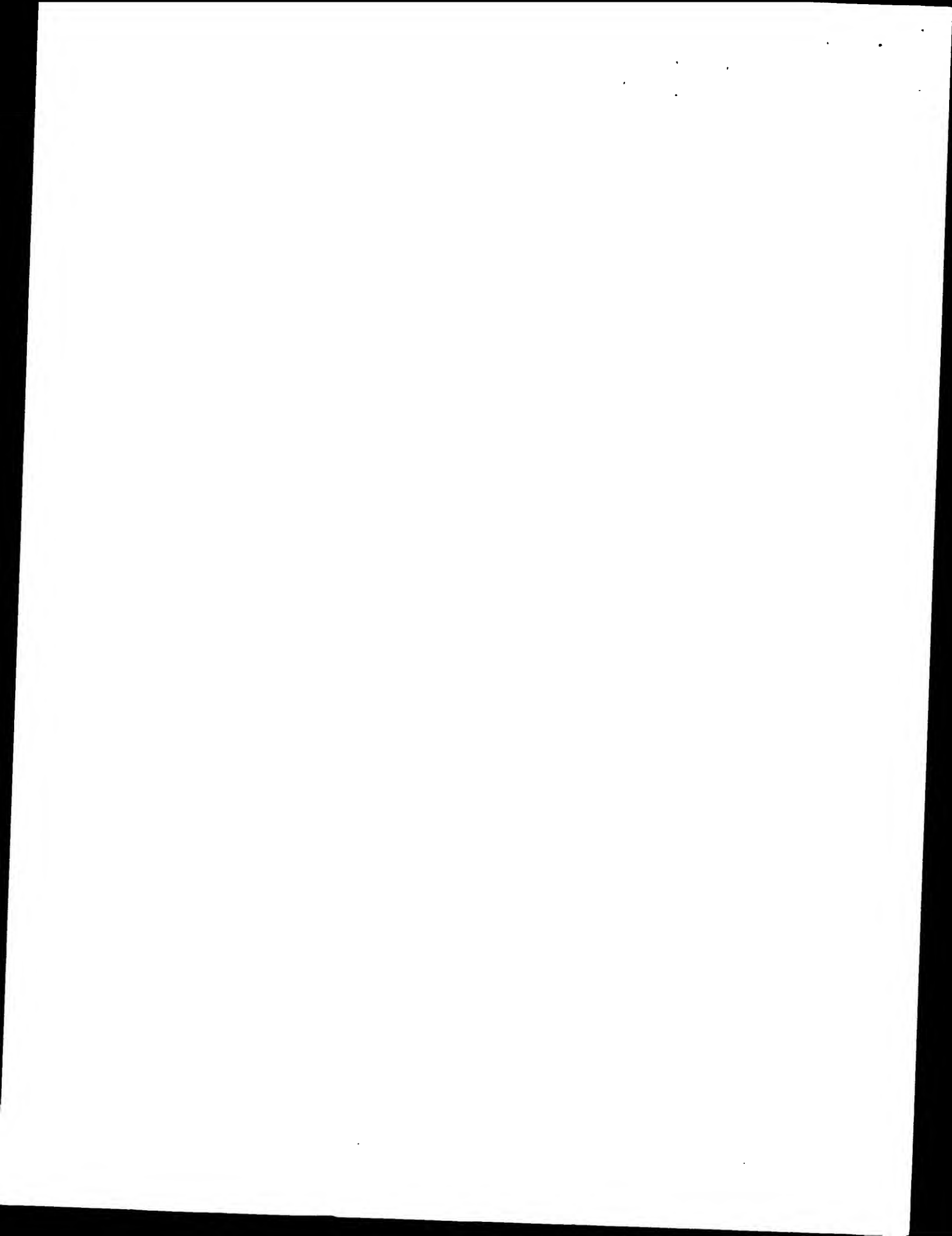
1. Reference is made to the following document:

D1: WO 98/09617.

2. D1, considered to be the closest prior art, describes an agent containing a material as per the present application, comprising a spongiform structure provided with a compound as per the present application (e.g. shellac, a cellulose ester such as cellulose acetate phthalate or hydroxypropyl methyl cellulose phthalate) which dissolves in the intestine (being in the form of a coating or of a receptacle). Active ingredients as per the present application can be used.

There is no other difference between the method for producing the spongy structure according to D1 and that according to the present application; accordingly, both structures must be characterised by three-dimensional polymer networks.

/...



D1 also describes the use of the agent for the production of pharmaceuticals that contain active ingredients as per the present application, of foodstuffs and of dietary supplements.

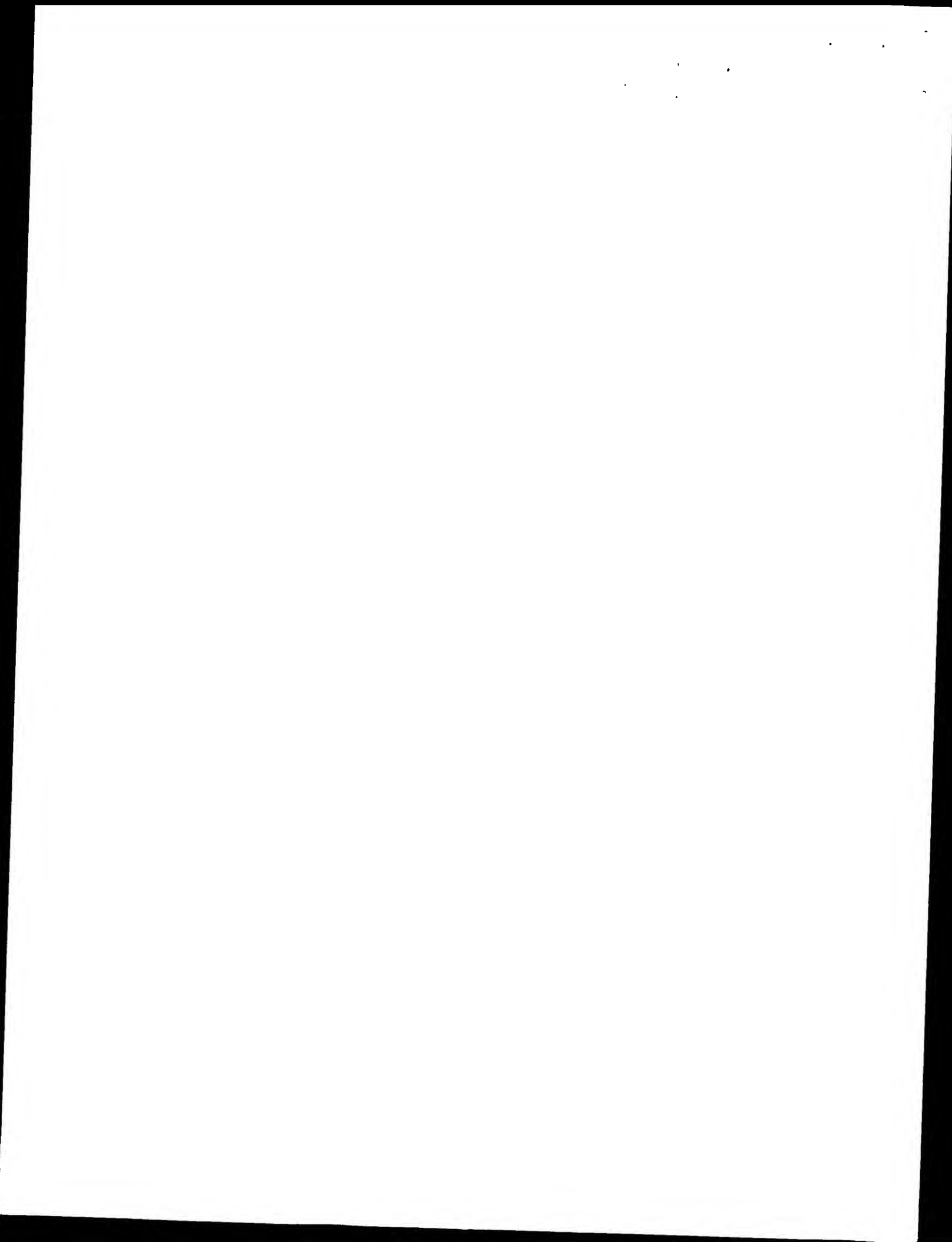
3. The subject matter of Claims 1-3, 5-7, 8-11, 12, 13 and 15 is included in the disclosures of D1, which document is therefore prejudicial to the novelty of said claims (PCT Article 33(2)).
4. With regard to the determination of novelty, it should be noted that information relating to an intended special form of the use but not considered to comprise distinctive features must be disregarded.
5. The subject matter of Claim 4 can be considered to be novel since it was not explicitly described in D1.

In view of the combined disclosures of the cited prior art, however, the claimed features constitute a conventional measure for the solution of the problem of interest.

Therefore, the subject matter of Claim 4 does not involve an inventive step and in consequence fails to satisfy the requirements of PCT Article 33(3).

6. The subject matter of Claim 14 is not described in the prior art citations, nor can it be derived in a straightforward manner therefrom. Said claim meets the requirements of PCT Article 33(2) and (3).

/...



7. The PCT Contracting States do not have uniform criteria for assessing the industrial applicability of Claim 16 in its present form. Patentability may depend on the wording of the claims. The EPO, for example, does not recognise the industrial applicability of claims to the medical use of a compound; it does, however, allow claims to the first medical use of a known compound or to the use of such a compound in the manufacture of a drug for a new medical application.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

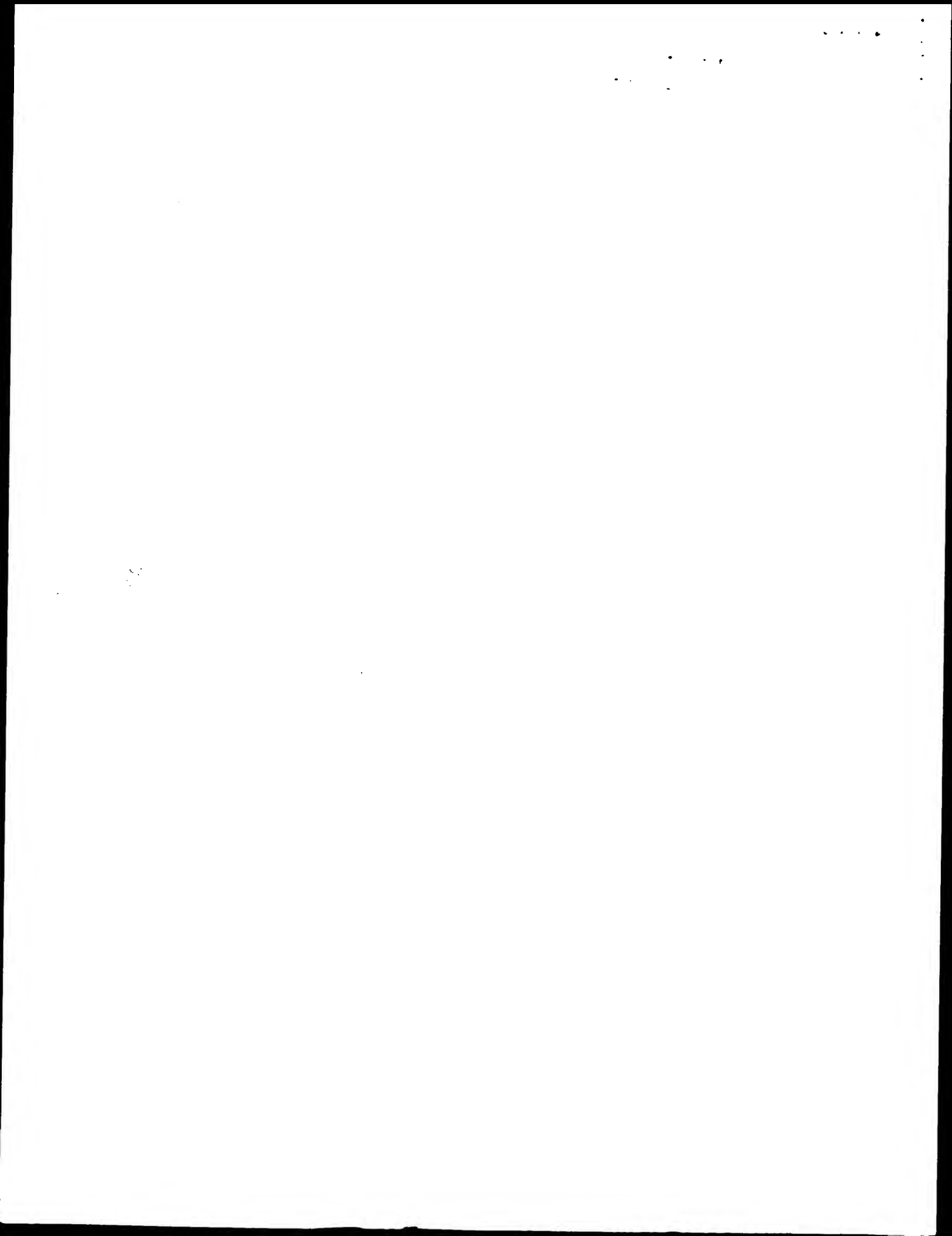
International application No.

PCT/EP 00/08647

VII. Certain defects in the international application

The following defects in the form or contents of the international application have been noted:

Contrary to PCT Rule 5.1(a)(ii), the description does not cite D1 or indicate the relevant prior art disclosed therein.



Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

| | | |
|---|--|---|
| Applicant's or agent's file reference BE19806PCT | FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416) | |
| International application No. PCT/EP00/08647 | International filing date (day/month/year) 05 September 2000 (05.09.00) | Priority date (day/month/year) 06 September 1999 (06.09.99) |
| International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 9/20, A61P 1/00 | | |
| Applicant BEISEL, Günther | | |

- This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
- This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.
☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).
These annexes consist of a total of sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☒ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☒ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

| | |
|---|---|
| Date of submission of the demand 06 April 2001 (06.04.01) | Date of completion of this report 23 November 2001 (23.11.2001) |
| Name and mailing address of the IPEA/EP | Authorized officer |
| Facsimile No. | Telephone No. |

Form PCT/IPEA/409 (cover sheet) (July 1998)

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP00/08647

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☒ the description: _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
pages _____
- ☒ the claims: _____, as originally filed
pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
pages _____
- ☐ the drawings: _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
pages _____
- ☐ the sequence listing part of the description: _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
pages _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.
These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP00/08647

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

1. The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

☐ the entire international application.

☒ claims Nos. 16

because:

☒ the said international application, or the said claims Nos. 16
relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (specify):

See supplemental sheet.

☐ the description, claims or drawings (indicate particular elements below) or said claims Nos. _____
are so unclear that no meaningful opinion could be formed (specify):

☐ the claims, or said claims Nos. _____ are so inadequately supported
by the description that no meaningful opinion could be formed.

☐ no international search report has been established for said claims Nos. _____.

2. A meaningful international preliminary examination cannot be carried out due to the failure of the nucleotide and/or amino acid sequence listing to comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions:

☐ the written form has not been furnished or does not comply with the standard.

☐ the computer readable form has not been furnished or does not comply with the standard.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 00/08647

Supplemental Box
(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: III.1

Claim 16 relates to the therapeutic treatment of the human body (PCT Article 34(4)(a)(i) and Rule 67.1(iv)).

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 00/08647

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

| | | | |
|-------------------------------|--------|---------------|-----|
| 1. Statement | | | |
| Novelty (N) | Claims | 4, 14 | YES |
| | Claims | 1-3, 5-13, 15 | NO |
| Inventive step (IS) | Claims | 14 | YES |
| | Claims | 4 | NO |
| Industrial applicability (IA) | Claims | 1-15 | YES |
| | Claims | | NO |

2. Citations and explanations

1. Reference is made to the following document:

D1: WO 98/09617.

2. D1, considered to be the closest prior art, describes an agent containing a material as per the present application, comprising a spongiform structure provided with a compound as per the present application (e.g. shellac, a cellulose ester such as cellulose acetate phthalate or hydroxypropyl methyl cellulose phthalate) which dissolves in the intestine (being in the form of a coating or of a receptacle). Active ingredients as per the present application can be used.

There is no other difference between the method for producing the spongy structure according to D1 and that according to the present application; accordingly, both structures must be characterised by three-dimensional polymer networks.

/...

D1 also describes the use of the agent for the production of pharmaceuticals that contain active ingredients as per the present application, of foodstuffs and of dietary supplements.

3. The subject matter of Claims 1-3, 5-7, 8-11, 12, 13 and 15 is included in the disclosures of D1, which document is therefore prejudicial to the novelty of said claims (PCT Article 33(2)).

4. With regard to the determination of novelty, it should be noted that information relating to an intended special form of the use but not considered to comprise distinctive features must be disregarded.

5. The subject matter of Claim 4 can be considered to be novel since it was not explicitly described in D1.

In view of the combined disclosures of the cited prior art, however, the claimed features constitute a conventional measure for the solution of the problem of interest.

Therefore, the subject matter of Claim 4 does not involve an inventive step and in consequence fails to satisfy the requirements of PCT Article 33(3).

6. The subject matter of Claim 14 is not described in the prior art citations, nor can it be derived in a straightforward manner therefrom. Said claim meets the requirements of PCT Article 33(2) and (3).

7. The PCT Contracting States do not have uniform criteria for assessing the industrial applicability of Claim 16 in its present form. Patentability may depend on the wording of the claims. The EPO, for example, does not recognise the industrial applicability of claims to the medical use of a compound; it does, however, allow claims to the first medical use of a known compound or to the use of such a compound in the manufacture of a drug for a new medical application.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 00/08647

VII. Certain defects in the international application

The following defects in the form or contents of the international application have been noted:

Contrary to PCT Rule 5.1(a)(ii), the description does not cite D1 or indicate the relevant prior art disclosed therein.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
15. März 2001 (15.03.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/17510 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 9/20,
A61P 1/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/08647

(22) Internationales Anmeldedatum:
5. September 2000 (05.09.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
199 42 365.2 6. September 1999 (06.09.1999) DE
299 15 634.6 6. September 1999 (06.09.1999) DE

(71) Anmelder und

(72) Erfinder: ~~/~~BEISEL, Günther [DE/DE]; Schloss Laach,
D-40789 Monheim (DE).

(74) Anwalt: FITZNER, Uwe; Lintorfer Str. 10, D-40878
Ratingen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU,

CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,
TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eura-
sisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI,
FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE,
SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- Mit internationalem Recherchenbericht.
- Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen.

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: AGENT FOR STIMULATING BOWEL FUNCTION AND METHOD FOR PRODUCING THE SAME

(54) Bezeichnung: MITTEL ZUR STIMULANZ DER DARMTÄTIGKEIT SOWIE VERFAHREN ZU DESSEN HERSTEL-
LUNG

(57) Abstract: The invention relates to an agent for stimulating bowel function and/or for improving and/or normalizing the action
of the bowels. The inventive agent contains a material in the form of a spongy structure that comprises three-dimensional polymer
meshes. Said structure is provided with a compound that is exclusively soluble in the intestines, if the material can be decomposed in
the stomach and/or the small intestine. The invention further relates to a method for producing such an agent and to the use thereof.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft ein Mittel zur Stimulanz der Darmtätigkeit und/oder zur Verbesserung
und/oder Normalisierung des Stuhlgangs, enthaltend ein Material in Form eines schwammartigen Gebildes, das dreidimensionale
polymere Netzwerke aufweist und, sofern das Material im Magen und/oder Dünndarm abbaubar ist, mit einer Verbindung versehen
ist, die ausschliesslich im Darm löslich ist. Ferner betrifft die vorliegende Erfindung ein Verfahren zur Herstellung eines solchen
Mittels sowie dessen Verwendung.



WO 01/17510 A1



5 Mittel zur Stimulanz der Darmtätigkeit sowie Verfahren zu dessen
Herstellung

Die vorliegende Erfindung betrifft ein Mittel zur Stimulanz der Darmtätigkeit und/oder zur Verbesserung und/oder Normalisierung des Stuhlgangs.

10

Die US 3,688,763 beschreibt eine Methode zur Kollektion von zellulärem Material aus dem Dickdarm von Menschen. Der Patient schluckt eine Kapsel, deren äußere Schicht sich mit samt dem darunter befindlichen Behälter im Darm auflöst und einen komprimierten Schwamm freisetzt, der anschließend durch eine natürliche Darmentleerung ausgeschieden wird.

Bei seinem Transport durch den Darm werden durch den Schwamm die äußeren Zellen des Darmlumens abgeschabt und mit nach außen geschleppt. Dadurch werden auf einfache Weise den Patienten Darmzellen entnommen, mit dem Ziel diese anschließend auf Tumoren oder Krebszellen zu untersuchen.

Dieses System hat sich zur Aufgabe gemacht, Darmzellen zu Analyse Zwecken zu kollektieren. Eine gezielte Stimulation der Darmaktivität wird auf diese Weise jedoch nicht erreicht.

Aus der DE 4 025 912 ist ein Mittel zur oralen Einnahme bekannt, das aus einem im Magen lösbaren und den Inhalt freigegebenden Behälter besteht. Dieser ist mit einem Stoff gefüllt, der nach seinem Freisetzen im Magen sein Volumen vergrößert und dadurch dem Körper ein Sättigungsgefühl suggeriert.

Nachteilig bei diesem System ist, daß es allein auf die Füllung des Magens abstellt. Eine Anregung der Darmtätigkeit ist damit jedoch nicht
35 verbunden.

5

Aufgabe der vorliegenden Erfindung ist es, ein Mittel, enthaltend ein Material in Form eines schwammartigen Gebildes, das verformbar, formreduzierbar und/oder reversibel komprimierbar ist, zur Verfügung zu stellen, das die Speiseröhre und den Magen passiert und im Darm eine
10 stimulierende Wirkung auf die Darmaktivität entfaltet.

Diese Aufgabe wird dadurch gelöst, daß das schwammartige Gebilde überwiegend dreidimensionale polymere Netzwerke aufweist und, sofern das Material im Magen und/oder Dünndarm abbaubar ist, mit einer
15 Verbindung versehen ist, die ausschließlich im Darm löslich ist.

Die Auflösung der Verbindung wird dabei durch verschiedene, z. T. auch gleichzeitig im Darm vorherrschende Parameter beeinflußt, wie z. B. pH-Wert, Druck, Redoxpotential und enzymatische Auflösung durch die
20 Darmflora. Darüber hinaus beeinflußt auch die Verweilzeit des Mittels im Darm die Geschwindigkeit mit der sich die Verbindung auflöst.

Vorzugsweise löst sich die Verbindung bei einem pH-Wert zwischen 5 und 10, bevorzugt zwischen 7 und 9, besonders bevorzugt zwischen 5,5 und
25 8,5 auf. Höchst bevorzugt ist eine Auflösung im pH-Milieu des Darms bei einem pH-Wert zwischen $6,4 \pm 0,6$ bis $7,0 \pm 0,7$. Es eignen sich insbesondere solche Verbindungen, die sich in Abhängigkeit von dem Redoxpotential, enzymatischen Aktivitäten und Druck auflösen.

30 Die Verbindung wird erfindungsgemäß bevorzugt in Form einer Beschichtung auf das schwammartige Gebilde aufgebracht, die gegebenenfalls auch aus mehreren Schichten aufgebaut sein kann. Die Mindestschichtdicke kann dabei erheblich variieren und ist abhängig von dem verwendeten Filmbildner und seiner Zusammensetzung. Osterwald
35 H. et al. (Acta Pharm Technol, 1980, 26: 201-209) beschreibt

5 beispielsweise eine Mindestschichtdicke von 46 μm für die Zubereitung eines Filmbildners in organischen Lösungsmitteln, mit Ammoniumsalzlösung zubereitet sind 161 μm Schichtdicke erforderlich, als Emulsion 46 μm und als Latexdispersion 52 μm Schichtdicke. Erfindungsgemäß liegt die Schichtdicke zwischen 10 μm bis mehrere
10 Millimeter, bevorzugt zwischen 15 μm bis 3 mm.

Anstelle einer direkt auf das Gebilde aufgetragenen Beschichtung kann das schwammartige Gebilde jedoch auch in ein Behältnis eingebracht werden, das sich unter den oben beschriebenen Bedingungen auflöst.
15 D.h., das Behältnis ist im Magen beständig, während es sich im Darm auflöst.

In einer anderen Variante der Erfindung kann die Verbindung in das schwammartige Gebilde eingebracht sein. Dies läßt sich beispielsweise
20 durch Vermischen des Materials mit der Verbindung bereits bei der Herstellung des schwammartigen Gebildes erreichen. Bevorzugt kann dies auch durch Tränken des Materials in einer Lösung der Verbindung erzielt werden. Selbstverständlich kann ein derartiges Gebilde zusätzlich auch mit einer Beschichtung der Verbindung versehen sein. Ebenso kann z.B.
25 das getränkte Gebilde auch in das oben beschriebene Behältnis eingebracht sein. Ferner kann das Gebilde in ein Behältnis eingebracht sein, das seinerseits mit der Verbindung beschichtet oder durchtränkt ist oder in das die Verbindung eingebracht ist.

30 Die zeitliche und lokale Auflösung der Verbindung läßt sich durch die Auswahl und Kombination der Verbindungen beeinflussen, wodurch eine gezielte Freisetzung des schwammartigen Gebildes im Darm und insbesondere in den verschiedenen Darmabschnitten, wie Jejunum, Ileum und Kolon, erreicht wird. Die Löslichkeit der Verbindungen kann dabei von
35 einem oder mehreren Faktoren abhängig sein, wie beispielsweise pH-

- 5 Wert, Einwirkzeit, Redoxpotential des Darmes, enzymatische Aktivitäten der Darmflora oder Druck, der durch die intestinale Peristaltik erzeugt wird. Die verschiedenen Möglichkeiten zur Steuerung der Freisetzung von Wirkstoffen sind zahlreiche beschrieben. Die pH-abhängige Löslichkeit wird beispielsweise bei *Marvola et al.*, Eur J Pharm Sci, 1999, 7:259-267 und
- 10 *Khan ZI et al.*, J Controlled Release, 1999, 58:215-222 beschrieben. *Pozzi F. et al.*, J Controlled Release, 1994, 31:99-108; *Wilding IR et al.*, Pharmacol Ther, 1994, 62:97-124; *Niwa K. et al.*, J Drug Target, 1995, 3:83-89 und US-4871549 offenbaren Systeme, die die Wirkstoffe in Abhängigkeit von der Zeit freisetzen. Beispiele für Systeme mit einer
- 15 kombinierten pH-Wert und Zeitabhängigkeit sind in *Rodriguez M. et al.*, J Controlled Release, 1998, 55:67-77 und *Gazzinga A. et al.*, STP Pharm Sci, 1995, 5:83-88 beschrieben. Mit der Auflösung von Verbindungen, bedingt durch ein verändertes Redoxpotential im Darm, beschäftigen sich *Bronsted H. et al.*, Pharm Res 1992, 9:1540-1545; *Yeh PY et al.*, J
- 20 Controlled Release, 1995, 36: 109-124; *Shanta KL et al.*, Biomaterials, 1995, 16:1313-1318 und *Kimura Y et al.*, Polymer, 1992, 33: 5294-5299. Beispiele für Systeme, die durch die Enzyme der Darmflora freigesetzt werden, sind in *Ashford M et al.*, J Controlled Release, 1994, 30:225-232; *Fernandez-Hervas MJ et al.*, Int J Pharm, 1998, 169:115-119; EP-
- 25 0460921; US-4432966 und *Milojevic S et al.*, J Controlled Release, 1996, 38:75-84; beschrieben. Die Auflösung von Systemen durch den Druck der intestinalen Peristaltik wird in *Muraoka M et al.*, J Controlled Release, 1998, 52:119-129 behandelt.
- 30 Erfindungsgemäß bevorzugt werden dabei folgende Verbindungen und deren Kombinationen, die jedoch keineswegs limitierend für die vorliegende Erfindung sind:
- Hydroxypropyl-methylcellulose-phthalat (HPMCP 55), Hydroxypropyl-
- 35 methylcellulose-acetat-succinat (Aqoat AS-MF. Aqoat AS-HF), 1:1

5 Kopolymer aus Methacrylsäure und Ethylacrylat (Eudragit®L), Kopolymer aus Vinylacetat und Crotonsäure (Coating CE 5142), Cellulose-acetat-phthalat (CAP, Aquateric), Methacrylat-Kopolymere (Eudragit®S), Schellack, Time Clock System®, Carnaubawachs, Hydroxypropylmethylcellulose (TC-5), Pulsincap®, Polyethylenglykol, vernetztes
10 Polyethylenglykol, Ethylcellulose, Ethylcellulose-Ethanol-Gemisch, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose, Glycerin-Monostearat, Eudragit®E. Ebenso sind Hydrogele aus Azo-Verbindungen möglich, wie beispielsweise N-substituiertes Methacrylamid, N-tert-butylacrylamid, Acrylsäure in Gegenwart von 4,4'-Bis-(methacryloylamino)-
15 azobenzen, 4,4'-Bis(N-methacryloyl-6-aminohexanoylamino)azobenzen oder 3,3',5,5'-Tetrabromo-4,4',4',4'-tetra(methacryloylamino)azobenzen. Beispiele für weitere Verbindungen sind lineare Polymervorstufen, beispielsweise enthaltend N,N-Dimethylacrylamid, N-tert-Butylacrylamid, Acrylsäure, N-Methacryloyl-glycyl-glycin-p-nitrophenylester, quervernetzt
20 durch geeignete Vernetzter, wie z.B. N,N'-(ω -aminocaproyl)-4,4'-diaminoazobenzen sowie Polymere enthaltend Azoverbindungen, wie beispielsweise 2-Hydroxy-ethyl-Methacrylat, 4-(Methacryloyloxy)azobenzen, N-(2-hydroxypropyl)methacrylamid-Kopolymere, Kopolymere enthaltend Styrol und 2-Hydroxyethylmethacrylat vernetzt durch
25 beispielsweise 4,4'-Divinylazobenzen oder N,N'-Bis-(β -steryl-sulfonyl)-4,4'-diaminoazobenzen. Ebenso sind erfindungsgemäß Poly(ether-ester)azo-Polymere einsetzbar, wie beispielsweise Kopolymere enthaltend 4-[4-[(6-hydroxyhexyl)oxy]phenyl]azobenzoessäure und 16-Hydroxyhexadecansäure, Kopolymere enthaltend 4-[2-[2-(2-hydroxyethoxy)-ethoxy]ethoxy]benzoessäure, 4-[4-[2-[2-(2-hydroxyethoxy)ethoxy]ethoxy]-phenyl]azobenzoessäure und 16-Hydroxyhexadecansäure oder 12-Hydroxydodecansäure sowie segmentierte Polyurethane enthaltend m-Xylen-Diisocyanat, 3,3'-Dihydroxyazobenzen, Polyethylenglykol oder 1,2-Propandiol. Ferner einsetzbar sind Azoverbindungen enthaltende

30

5 Polyamide oder Kopolymere aus 4-[4-(chlorocarbonyl)phenyl]-azobenzoylchlorid und α,ω -Bis(aminopropyl)-poly(tetramethylenoxid) sowie Kopolymere aus 4-[4-(Chlorocarbonyl)phenyl]azobenzoylchlorid und Jeffamine ED-600.

Ferner finden Pektine Verwendung, die zusätzlich ummantelt oder in einer
10 Matrix eingebettet werden können, wie beispielsweise Methoxy-Pektin, amidiertes Pektin, Calciumpektinat, Pektin in Kombination mit Ethylcellulose (Aquacoat, Surelease), Acrylsäureester-Polymere (Eudragit RS30D, Eudragit NE30D). Ebenso finden Kombinationen von Pektinen mit anderen Ballaststoffen Einsatz. Beispiele für Ballaststoffe sind Guar
15 (Galactomannan) oder Chitosan, wobei die Ballaststoffe selbst wiederum ummantelt oder Bestandteil einer Matrix sein können. Hierbei finden folgende Substanzen Einsatz als Filmbildner: Polymethacrylatlösungen, Kopolymerisate enthaltend Polyurethan und Di-, Oligo- oder Polysaccharide (Galactomannane) sowie Ethylgalactomannane oder
20 Acetylgalactomannane. Ebenso finden Cyanoacrylat, Inulin, Inulin-Suspensionen mit Eudragit-RS, methacryliertes Inulin, Chondroitinsulfat, Chondroitin-Polymere enthaltend 1,12-Diaminododecan und Dicyclohexylcarbodiimid, amorphe Amylose oder amorphe Amylose zusammen mit anderen filmbildenden Polymeren als Filmbildner Einsatz.
25 Ebenso können Dextrane verwendet werden, die verschiedenartig vernetzt sein können, beispielsweise mit Diisocyanaten, Fettsäureestern, beispielsweise der Laurylsäure, Glutaraldehyd. Auch Konjugate aus Biphenylessigsäure und β -Cyclodextrin, Filme aus β -Cyclodextrinen mit Methacrylsäure-Kopolymeren oder Acrylsäurepolymere mit
30 Disaccharidseitengruppen kommen erfindungsgemäß zum Einsatz.

Die Auswahl der Verbindungen sowie deren vielfältige Kombinationsmöglichkeiten ermöglichen eine gezielte Freisetzung des schwammartigen Gebildes im Darm.

5 Ferner betrifft die vorliegende Erfindung ein Mittel zur Verwendung zur Stimulanz der Darmtätigkeit sowie zur Verbesserung und/oder Normalisierung des Stuhlgangs, enthaltend ein Material in Form eines schwammartigen Gebildes, das 3-dimensionale polymere Netzwerke aufweist und, sofern das Material im Magen und/oder Dünndarm abbaubar
10 ist, mit einer Verbindung versehen ist, die ausschließlich im Darm löslich ist.

Unter schwammartigen Gebilden sind erfindungsgemäß Schäume zu verstehen, die aus gasgefüllten, kugel-polyederförmigen Zellen bestehen,
15 welche durch hochviskose oder feste Zellstege begrenzt sind. Einsetzbar sind erfindungsgemäß sowohl natürlich vorkommende Schwämme als auch synthetisch hergestellte schwammartige Gebilde.

Die Herstellung der schwammartigen bzw.-förmigen Gebilde erfolgt mit an
20 sich bekannten Methoden nach dem Stand der Technik. In Abhängigkeit von dem eingesetzten Ausgangsmaterial kann im einfachsten Falle ein Schaum durch Einblasen, durch Schlagen, Schütteln, Verspritzen oder Rühren in der betreffenden Gasatmosphäre erhalten werden. Bei den Polymeren entsteht die Schaumstruktur aufgrund chemischer Reaktionen.
25 So werden bei den Polyurethanen durch Zugabe von Blähmitteln, die sich bei bestimmter Temperatur während der Verarbeitung unter Gasbildung zersetzen, oder durch Zusatz von flüssigen Lösemitteln während der Polymerisation geschäumt. Die Verschäumung erfolgt entweder beim Verlassen des Extrusionswerkzeuges, d.h. im Anschluß an das
30 Extrudieren oder Spritzgießen oder in offenen Formen. Die Härtung erfolgt unter den für die jeweilige chemische Verbindung des Materials charakteristischen Bedingungen.

Unabdingbare Voraussetzung für die Einsetzbarkeit des Materials ist, daß
35 es komprimierbar ist, ohne daß die Zellstege brechen. Für die Auswahl

- 5 des Materials und die Art der Schaumbildung ist ferner wesentlich, daß es quellfähig bleibt, ohne daß die Zellstege zerstört werden.

Um Verstopfungen des Darmes oder schlimmstenfalls sogar einem Darmverschluß vorzubeugen, ist das Volumen der dekomprimierten
10 schwammartigen Gebilde entsprechend auszuwählen. Um auch mit kleineren schwammartigen Gebilden den gewünschten stimulierenden Effekt auf die Darmaktivität zu erreichen, kann die orale Einnahme mehreren erfindungsgemäßer Mittel erfolgen.

- 15 Das schwammartige Gebilde kann im dekomprimierten Zustand jede beliebige Form und Größe haben. Bevorzugt sind jedoch quaderförmige oder rechtecksförmige oder runde Ausgestaltungen.

Vorzugsweise ist das Material so ausgelegt, daß das schwammartige
20 Gebilde auf $1/2$ bis $1/100$ vorzugsweise $1/4$ bis $1/50$, besonders bevorzugt $1/10$ bis $1/20$ seines Volumens bzw. seiner Größe komprimierbar ist. Unter physiologischen Bedingungen soll das komprimierte Material sich nach der Passage durch Speiseröhre und Magen vorzugsweise auf das Zwei- bis Hundertfache, besonders bevorzugt auf das Vier- bis Fünzfache, ganz
25 besonders bevorzugt auf das Zehn- bis Zwanzigfache seines Volumens im Darm ausdehnen können.

Für das schwammartige Gebilde sind erfindungsgemäß natürliche, halbsynthetische oder synthetische Polymere einsetzbar. Beispiele
30 geeigneter synthetischer Polymere sind Polyurethane, Polyacrylate, Poly(meth)acrylsäureester, Homo- und Copolymere des Vinylacetats. Zu den natürlichen und halbsynthetischen Polymeren zählen u.a. Cellulose, Cellulose-Ether, Diethylcellulose oder Celluloseester, wie Cellulosediacetat, Celluloseetriacetat, Celluloseacetat-Propionat,
35 Celluloseacetat und Cellulose-Butyrat. Erfindungsgemäß geeignet sind

5 z.B. Cellulosederivate, insbesondere entsprechende Ether, z.B. Methylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropyl-methylcellulose, oder Natriumcarboxymethylcellulose (vorzugsweise solche Verbindungen mit höherer Viskosität); natürliche (anionische) Schleimstoffe, z.B. Xanthan Gummi, Guar Gummi, Traganth oder Alginsäure und Salze
10 davon, und dergleichen. Darüber hinaus ist auch der Einsatz unlöslicher Polysaccharide, wie Chitin bzw. Chitinderivate oder mikrokristalliner Cellulose denkbar. Erfindungsgemäß besonders bevorzugt werden linerare hochmolekulare Polymere. Vor allem sind erfindungsgemäß solche Polymere einsetzbar, die Faserstruktur besitzen. Beispiele für
15 solche Stoffe sind die Skleroproteine, wie Keratine, Conchagene, Fibroin, Elastine und Collagen.

Ebenso kommen stabil vernetzte Polymere in Betracht. Insbesondere sind hier Uronsäure-haltige Polysaccharide oder deren Salze denkbar, die durch ionische Bindungen miteinander vernetzt sind und durch zusätzliche
20 kovalente Bindungen, beispielsweise durch mineralhaltige Säuren katalysierte Esterbindungen, stabil quervernetzt sind.

In einer besonderen Ausführungsvariante der Erfindung können sich die Polymere auch bereits im Magen dekomprimieren und in diesem Zustand
25 in den Darm gelangen und diesen passieren. Als Materialien in Form eines schwammartigen Gebildes kommen hier insbesondere solche in Betracht, die in gastrointestinalen Flüssigkeiten kaum merklich bis garnicht abbaubar oder resorbierbar sind.

30

Die vorliegende Erfindung betrifft ferner ein Verfahren zur Herstellung des oben beschriebenen Mittels. Dabei wird prinzipiell zunächst eine Suspension der Materialien für das schwammartige Gebilde hergestellt und anschließend gefriergetrocknet. Gegebenenfalls wird zuvor das
35 Material für das schwammartige Gebilde zerkleinert und/oder einer

- 5 alkalischen und/oder einer sauren Vorbehandlung unterworfen. Die Gefriertrocknung wird vorzugsweise bei -80 bis +50°C, insbesondere bei -30 bis +40°C durchgeführt.

Das resultierende Material wird anschließend komprimiert. Dies kann
10 durch Pressen, Walzen oder vergleichbare Methoden geschehen. In einer besonderen Ausführungsform der Erfindung kann auch eine Komprimierung des Materials durch Kaubewegungen bei der oralen Einnahme des Materials erfolgen.

- 15 Das so hergestellte schwammartige, komprimierte Gebilde kann in einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung mit der oben beschriebenen Verbindung versehen werden. D.h., entweder wird aus der Verbindung ein Behältnis, z.B. eine Kapselhülle, hergestellt und in diese das schwammartige Gebilde eingebracht. Oder auf das Gebilde wird die
20 Verbindung direkt aufgebracht, etwa durch Tauchen, Besprühen, Aufstreichen oder ähnliche Methoden.

In einer anderen Ausführungsform der Erfindung wird die Verbindung in das schwammartige Gebilde eingebracht. Dies kann z.B. durch Tränken erreicht werden.

- 25 Ferner ist denkbar, daß die Verbindung bereits bei der Herstellung des Materials durch direktes Vermischen von Material und Verbindung in das schwammförmige Gebilde eingebracht wird.

Zweck des erfindungsgemäßen Verfahrens ist es, ein Mittel zu erhalten,
30 das im Darm in dekomprimierter Form vorliegt und so eine stimulierende Wirkung auf die Darmaktivität ausübt. Dieses Ziel wird mit den genannten Verfahrensschritten erreicht.

Im Gegensatz zu anderen Lebensmittel-/Nahrungsergänzungs-/Diät- oder Arzneimittelprodukten, die kurzfristig im Darm zersetzt werden oder schon
35 in zerkleinertem Zustand in den Darm gelangen, behält der aus

5 natürlichen, halbsynthetischen oder synthetischen sowie stabil vernetzten Polymeren bestehende, in der beschriebenen Weise hergestellte Schwamm- oder Schaumkörper durch sein überwiegend dreidimensionales polymeres Netzwerk über mehrere Stunden seine ursprünglich vorhandene Form. Das erfindungsgemäße Mittel übt somit im
10 Darm eine Wirkung aus, die mit der eines Ballaststoffes vergleichbar ist und aufgrund dessen die Darmaktivität stimuliert.

Hierbei liegt das erfindungsgemäße Mittel beim Durchtritt durch die Speiseröhre sowie bei der Passage des Magens oder Dünndarms in ausreichend komprimierter Form vor, um sich im Darm, insbesondere im
15 Dickdarm zu dekomprimieren und die gewünschte Wirkung zu entfalten.

In einer besonderen Ausführungsvariante der Erfindung kann das Mittel jedoch auch bereits im Magen dekomprimieren und in diesem Zustand in den Darm gelangen und diesen passieren. Dies trifft insbesondere für
20 Materialien zu, die den Magen und Dünndarm auch in dekomprimierter Form passieren können ohne abgebaut zu werden.

Für den besonderen Fall, daß der Abbau des Materials jedoch bereits im Magen oder Dünndarm beginnen sollte, muß ein entsprechender Schutz
25 vor frühzeitiger Degradation erfolgen. Ein solcher Schutz, kann dadurch erzielt werden, daß das Material mit einer Verbindung versehen ist, die sich ausschließlich im Darm auflöst. Hierbei kann diese Verbindung auf die bereits zuvor erwähnte Weise in/auf das Material ein-/ aufgebracht werden oder damit umhüllt werden.

30

Anderenfalls ist es aber auch durchaus denkbar, daß das erfindungsgemäße Mittel sozusagen fakultativ mit einer zuvor besagten Verbindung versehen werden kann.

5 Durch eine gegebenenfalls auf/in das Gebilde auf-/eingebrachte Verbindung bzw. eine Umhüllung daraus, besteht zum einen die Möglichkeit, das Material vor frühzeitigem Abbau zu schützen und zum anderen den Ort der Dekompression des Materials zu beeinflussen.

10 Durch das erfindungsgemäß im Darm dekomprimierte Mittel erfolgt eine Anregung der Dehnungsrezeptoren der Darmwand, die ihrerseits Kontraktionen des Darmes auslösen. Dies bewirkt die erwünschte Stimulation der Darmaktivität und resultiert in einer Verkürzung der Passagezeit des Darminhaltes.

15

In einer Ausführungsform des erfindungsgemäßen Verfahrens, die die Erfindung näher beschreibt, jedoch nicht darauf limitiert, kann als schwammartiges Gebilde lösliches Collagen aus den Häuten junger Tiere, insbesondere Rinder oder Schweine, eingesetzt werden. Die löslichen
20 Collagenanteile in der Haut von Tieren werden nämlich mit zunehmendem Alter des Organismus immer geringer, da das Collagen durch intermolekulare Vernetzung ein unlösliches dreidimensionales Netzwerk bildet. Die Vernetzungsstellen sind feste chemische Bindungen zwischen einzelnen Collagenmolekülen.

25

Bei der Herstellung der notwendigen Collagensuspensionen für die Schwammherstellung müssen deshalb die Häute aus 1 bis 2 Jahre alten Tieren (Bullen) stammen. Hier bildet das Collagen schon ein unlösliches Netzwerk. Durch eine stark alkalische und saure Vorbehandlung der Haut
30 und mechanische Kräfte beim Herstellen der Schwamm-Suspension, kann es dazu kommen, daß einzelne chemische und physikalische Vernetzungsstellen im Collagen gelöst werden.

Bei der Trocknung des Schwamms durch Gefriertrocknung und
35 anschließende Erhitzung bei 90 °C bis 130 °C, vorzugsweise 120 °C

- 5 werden wieder neue Vernetzungsstellen durch die relativ hohen Temperaturen in das Schwammmaterial eingeführt.

Dies bewirkt eine langandauernde Unlöslichkeit des Schwammkörpers in gastrointestinalen Flüssigkeiten und/oder Wasser. Diese relative
10 Unlöslichkeit ist Voraussetzung für eine relativ feste und stabile Struktur, die einen anhaltenden stimulierenden Effekt und damit eine laxative (abführende) Wirkung im Darm auslöst.

Bei einer bevorzugten Ausführungsvariante der vorliegenden Erfindung
15 werden zur Herstellung der schwammartigen Gebilde stabil vernetzte Polyuronsäure-haltige Polysaccharide eingesetzt. Besonders bevorzugt sind Alginate oder deren Salze. Die Polymere sind hier neben ionischen Bindungen zusätzlich durch kovalente Bindungen, insbesondere durch mineralhaltige Säure katalysierte Esterbindungen, stabil miteinander
20 quervernetzt.

Die Erfindung ist nicht auf die beschriebenen Verfahren beschränkt, sondern gilt auch für alle anderen Verfahren, bei denen Schwämme, schwammähnlichen Gebilde oder Gele hergestellt werden, die durch die
25 relative Unlöslichkeit in Wasser und/oder gastrointestinalen Flüssigkeiten, gegebenenfalls durch entsprechend geeignete Verbindungen unterstützt, eine langfristige Stimulierung der Darmtätigkeit erzielen sollen oder können.

30 Das erfindungsgemäße Mittel wird oral eingenommen. Der komprimierte Schwamm- oder feste Schaumkörper passiert durch Hinzufügen von Trinkflüssigkeit sowie leichte Kau- oder Schluckbewegungen Mund, Rachen, Speiseröhre und gegebenenfalls Magen und schwemmt vorzugsweise zu seinem ursprünglichen Volumen im Darm wieder auf.

- 5 Gegebenenfalls kann das Volumen auch größer oder kleiner als das ursprüngliche sein.

Durch die orale Einnahme des erfindungsgemäßen Mittels wird erreicht, daß die Dehnungsrezeptoren im Darm angeregt werden, da der
10 komprimierte Schwamm- oder feste Schaumkörper durch die Schwerlöslichkeit im Darm eine feste und mechanisch stabile Struktur beibehält. Infolgedessen läßt sich eine langfristige Anregung der Darmtätigkeit erzielen, verbunden mit einem verbesserten Wasserbindungsvermögen des Stuhl, gefolgt von günstigeren
15 Wachstumsbedingungen der Darmflora, wodurch letztendlich die Darmsekretion und die Darmdurchblutung angeregt werden.

Demgemäß findet das erfindungsgemäße Mittel Verwendung zur Stimulanz der Verdauungs-/Darmtätigkeit, zur Verbesserung und/oder
20 Normalisierung des Stuhlgangs sowie zur Verkürzung der Passagezeit des Speisebreis im Darm, verbunden mit einer laxativen (abführenden) Wirkung. Ebenso kann das Mittel aber auch in den Bereichen der Pharmazie und/oder des Gesundheitswesens, bevorzugt der (Diät)-Ernährung oder Nahrungsergänzung zum Einsatz kommen.

25

Die vorliegende Erfindung betrifft somit ferner die Verwendung des erfindungsgemäßen Mittels zur Herstellung von Mitteln zur Stimulanz der Darmtätigkeit sowie zur Verbesserung und/oder Normalisierung des Stuhlgangs sowie zur Herstellung von pharmazeutisch wirksamen Mitteln
30 und/oder Nahrungsmitteln und/oder Nahrungsergänzungsmitteln und/oder Diät-Nahrungsmitteln.

5 Patentansprüche:

1. Mittel zur Stimulanz der Darmtätigkeit und/oder zur Verbesserung und/oder Normalisierung des Stuhlgangs, enthaltend ein Material in Form eines schwammartigen Gebildes, **dadurch gekennzeichnet, daß** es 3-dimensionale polymere Netzwerke aufweist und, sofern das Material im Magen und/oder Dünndarm abbaubar ist, mit einer Verbindung versehen ist, die ausschließlich im Darm löslich ist.
2. Mittel nach Anspruch 1, **dadurch gekennzeichnet, daß** das schwammartige Gebilde mit der Verbindung beschichtet ist.
3. Mittel nach einem der Ansprüche 1 oder 2, **dadurch gekennzeichnet, daß** das schwammartige Gebilde in ein Behältnis eingebracht ist, das aus einer ausschließlich im Darm löslichen Verbindung besteht.
4. Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 3, **dadurch gekennzeichnet, daß** die Verbindung in das schwammartige Gebilde eingebracht ist.
5. Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 4, **dadurch gekennzeichnet, daß** die Verbindung in Flüssigkeiten mit einem pH-Wert von 5 bis 10 löslich ist.
6. Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 5, **dadurch gekennzeichnet, daß** die Verbindung in Flüssigkeiten mit einem pH-Wert von 5,5 bis 8,5 löslich ist.
7. Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 6, **dadurch gekennzeichnet, daß** die Verbindung in Flüssigkeiten mit einem

- 5 pH-Wert von $6,4 \pm 0,6$ bis $7,0 \pm 0,7$ löslich ist.
8. Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 7, **dadurch gekennzeichnet, daß** das schwammartige Gebilde natürliche, halbsynthetische oder synthetische Polymere sowie stabil vernetzte
10 Massen oder Kombinationen davon enthält.
9. Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 8, **dadurch gekennzeichnet, daß** das schwammartige Gebilde Collagen, Zellulose oder Alginat enthält.
- 15
10. Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 9, **dadurch gekennzeichnet, daß** das schwammartige Gebilde auf ein Halb- bis ein Hundertstel, vorzugsweise ein Viertel- bis ein Fünzigstel, besonders bevorzugt auf ein Zehntel bis ein Zwanzigstel seiner
20 ursprünglichen Größe komprimierbar ist.
11. Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 10, **dadurch gekennzeichnet, daß** das Material im Darm auf das Zwei- bis Hundertfache, vorzugsweise das Vier- bis Fünzigfache, besonders
25 bevorzugt auf das Zehn- bis Zwanzigfache seiner Größe im komprimierten Zustand dekomprimierbar ist.
12. Mittel gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Verwendung zur Stimulanz der Darmtätigkeit sowie zur
30 Verbesserung und/oder Normalisierung des Stuhlgangs, enthaltend ein Material in Form eines schwammartigen Gebildes, **dadurch gekennzeichnet, daß** es 3-dimensionale polymere Netzwerke aufweist und, sofern das Material im Magen und/oder Dünndarm abbaubar ist, mit einer Verbindung versehen ist, die ausschließlich
35 im Darm löslich ist.

5

13. Verfahren zur Herstellung eines Mittels zur Stimulanz der Darmtätigkeit nach einem der Ansprüche 1 bis 12, **dadurch gekennzeichnet, daß** ein Material in Form eines schwammartigen Gebildes reversibel komprimiert wird und gegebenenfalls auf dieses Gebilde eine Verbindung aufgebracht wird und/oder eine solche Verbindung in das schwammartige Gebilde eingebracht wird und/oder dieses Gebilde mit einer solchen Verbindung umhüllt wird.

10

14. Verwendung des Mittels gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung von Mitteln zur Stimulanz der Darmtätigkeit sowie zur Verbesserung und/oder Normalisierung des Stuhlgangs.

15

15. Verwendung des Mittels gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Herstellung von pharmazeutisch wirksamen Mitteln und/oder Nahrungsmitteln und/oder Nahrungsergänzungsmitteln und/oder (Diät)-Nahrungsmitteln.

20

16. Verwendung des Mittels gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Stimulanz der Darmtätigkeit und/oder zur Verbesserung und/oder Normalisierung des Stuhlgangs und/oder zur Verkürzung der Passagezeit des Speisebreis im Darm, verbunden mit einer laxativen Wirkung.

25



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter Application No

PCT/EP 00/08647

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 A61K9/20 A61P1/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BIOSIS, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|------------|---|-----------------------|
| X | EP 0 901 792 A (SUWELACK SKIN & HEALTH CARE AG) 17 March 1999 (1999-03-17) column 8, paragraph 40 column 8, paragraph 42 - paragraph 43 column 9, paragraph 49 -column 10, paragraph 51; claims 1,4,7-11,14,15,17,18; examples 1,3,4,7 | 1,2,6-16 |
| X | WO 98 09617 A (BEISEL GUENTHER) 12 March 1998 (1998-03-12) the whole document | 1,2,5-16 |
| X | US 3 688 763 A (CROMARTY RAYMOND) 5 September 1972 (1972-09-05) cited in the application the whole document | 1-8,12, 13 |
| -/- | | |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

8 January 2001

Date of mailing of the international search report

15/01/2001

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Marttin, E

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

.al Application No

PCT/EP 00/08647

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| A | WO 98 23259 A (BEISEL GUENTHER) 4 June 1998 (1998-06-04) the whole document ---- | 1-16 |
| P,X | DE 299 15 668 U (BEISEL GUENTHER) 23 March 2000 (2000-03-23) the whole document ---- | 1-16 |
| P,X | DE 299 15 656 U (BEISEL GUENTHER) 20 April 2000 (2000-04-20) the whole document ----- | 1-16 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Inter Application No

PCT/EP 00/08647

| Patent document cited in search report | | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|---|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| EP 0901792 | A | 17-03-1999 | DE 19739031 A | 11-03-1999 |
| | | | AU 709337 B | 26-08-1999 |
| | | | AU 7864098 A | 18-03-1999 |
| | | | CA 2245754 A | 05-03-1999 |
| | | | DE 29723220 U | 28-05-1998 |
| | | | JP 3045388 B | 29-05-2000 |
| | | | JP 11139993 A | 25-05-1999 |
| WO 9809617 | A | 12-03-1998 | AU 6988696 A | 26-03-1998 |
| | | | EP 0936903 A | 25-08-1999 |
| US 3688763 | A | 05-09-1972 | GB 1302548 A | 10-01-1973 |
| WO 9823259 | A | 04-06-1998 | AU 3091997 A | 22-06-1998 |
| | | | BR 9713303 A | 21-03-2000 |
| | | | CN 1247467 A | 15-03-2000 |
| | | | CZ 9901879 A | 13-10-1999 |
| | | | EP 0948316 A | 13-10-1999 |
| | | | SI 20007 A | 29-02-2000 |
| | | | SK 70299 A | 18-01-2000 |
| DE 29915668 | U | 23-03-2000 | NONE | |
| DE 29915656 | U | 20-04-2000 | NONE | |



1

2

3

4

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 A61K9/20 A61P1/00

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RESEARCHIERTE GEBIETE

Researchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 A61K

Researchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die researchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BIOSIS, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|--------------------|
| X | EP 0 901 792 A (SUWELACK SKIN & HEALTH CARE AG) 17. März 1999 (1999-03-17) Spalte 8, Absatz 40 Spalte 8, Absatz 42 - Absatz 43 Spalte 9, Absatz 49 - Spalte 10, Absatz 51; Ansprüche 1,4,7-11,14,15,17,18; Beispiele 1,3,4,7 | 1,2,6-16 |
| X | WO 98 09617 A (BEISEL GUENTHER) 12. März 1998 (1998-03-12) das ganze Dokument | 1,2,5-16 |
| X | US 3 688 763 A (CROMARTY RAYMOND) 5. September 1972 (1972-09-05) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument | 1-8,12, 13 |
| | -/- | |



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

G Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

8. Januar 2001

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

15/01/2001

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Marttin, E

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|--------------------|
| A | WO 98 23259 A (BEISEL GUENTHER) 4. Juni 1998 (1998-06-04) das ganze Dokument ---- | 1-16 |
| P,X | DE 299 15 668 U (BEISEL GUENTHER) 23. März 2000 (2000-03-23) das ganze Dokument ---- | 1-16 |
| P,X | DE 299 15 656 U (BEISEL GUENTHER) 20. April 2000 (2000-04-20) das ganze Dokument ----- | 1-16 |

INTERNATIONALER RESEARCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Inter. Kennzeichen

PCT/EP 00/08647

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | | Datum der Veröffentlichung | Mitglied(er) der Patentfamilie | | Datum der Veröffentlichung |
|--|---|-------------------------------|-----------------------------------|------------|-------------------------------|
| EP 0901792 | A | 17-03-1999 | DE | 19739031 A | 11-03-1999 |
| | | | AU | 709337 B | 26-08-1999 |
| | | | AU | 7864098 A | 18-03-1999 |
| | | | CA | 2245754 A | 05-03-1999 |
| | | | DE | 29723220 U | 28-05-1998 |
| | | | JP | 3045388 B | 29-05-2000 |
| | | | JP | 11139993 A | 25-05-1999 |
| WO 9809617 | A | 12-03-1998 | AU | 6988696 A | 26-03-1998 |
| | | | EP | 0936903 A | 25-08-1999 |
| US 3688763 | A | 05-09-1972 | GB | 1302548 A | 10-01-1973 |
| WO 9823259 | A | 04-06-1998 | AU | 3091997 A | 22-06-1998 |
| | | | BR | 9713303 A | 21-03-2000 |
| | | | CN | 1247467 A | 15-03-2000 |
| | | | CZ | 9901879 A | 13-10-1999 |
| | | | EP | 0948316 A | 13-10-1999 |
| | | | SI | 20007 A | 29-02-2000 |
| | | | SK | 70299 A | 18-01-2000 |
| DE 29915668 | U | 23-03-2000 | KEINE | | |
| DE 29915656 | U | 20-04-2000 | KEINE | | |



1
2
3

4
5
6